

Érvényesség: 1993.07.01 - 2003.06.30

POZ 01555

A

13 ①

Bejelentés ügyszáma: P9006007

Bejelentés napja: 19900921

Közzétételi szám: 55002

Adatközlés napja: 19910328

Lajstromszám: 207853

Közzététel napja: 19910429

Elsőbbségi adatok: DEP3931432 - 19890921

Megadás napja: 19930217

NSZO: C07D-239/28; C07D-401/06; C07D-403/06; C07D-413/06; C07D-417/06;

Megadás meghirdetése: 19930628

A61K-031/505

Magyar cím:

Eljárás pirimidin-4,6-dikarbonsav-diamidok előállítására

Angol cím:

PROCESS FOR PRODUCING PYRIMIDINE-4,6-DICARBOXYLIC ACID-DIAMIDES

Bej. Ientő:

Hoechst Ag., Frankfurt/Main, DE

Feltaláló:

dr. Baader, Ekkehard, Königstein/Taunus, DE

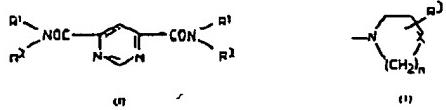
dr. Bickel, Martin, Bad Homburg, DE

dr. Günzler-Pukall, Volkmar, Marburg, DE

dr. Henke, Stephan, Hofheim/Taunus, DE

Képviselő:

Danubia Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft., Budapest



Kivonat:

A találmány tárgya eljárás (I) általános képletű vegyületek és fiziológiailag alkalmas sóik előállítására, ahol

R1 jelentése 1-12 szénatomos alkilcsoport, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, vagy 2-12 szénatomos alkiniilcsoport, amelyek adott esetben szubsztituáltak lehetnek, vagy

R1 jelenthet még telített 5-7 szénatomos cikloalkil-csoportot, amely adott esetben benzolgyűrűhöz kapcsolódhat, vagy

R1 jelenthet továbbá adott esetben szubsztituált aril- vagy heteroarilcsoportot, vagy

R1 jelentése akkor amikor R2 hidrogénatomot jelent, aminocsoport is lehet, amely szubsztituálatlan vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, fenilcsoporttal vagy 1-3 szénatomos alkil-karbonilcsoporttal monovagy diszubsztituált lehet, és

R2 jelentése hidrogénatom vagy megegyezik R1 jelentésével, ahol R2 és R1 jelentése azonos vagy különböző, vagy R1 és R2 együttesen a közbezárt nitrogénatommal együtt egy (1) általános képletű csoportot alkot, ahol

n értéke 1 és 3 közötti egész szám, és

X jelentése oxigénatom, kénatom, metiléncsoport vagy egy /N-R3 általános képletű csoport, és

R3 jelentése hidrogénatom vagy adott esetben helyettesített fenilcsoport, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, vagy 2-6 szénatomos alkiniilcsoport, vagy

R3 jelentése egy -N(R4)2 általános képletű csoport, ahol R4 jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport, vagy

R3 jelenthet még egy COOR5 általános képletű csoportot, ahol R5 jelentése hidrogénatom, vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport, vagy jelenthet egy -CON(R6)2 általános képletű csoportot, ahol

R6 jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport vagy (R6)2 jelentése egy 4-6 szénatomos alkilénlánc, amelyben egy a nitrogénatommal nem közvetlenül szomszédos -CH2-csoport helyett egy oxigénatom, kénatom vagy egy /N-R4-csoport állhat, vagy

R3 jelenthet még egy 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoportot vagy 3-7 szénatomos cikloalkilcsoportot.

A vegyületek a prolin- és liszinhidroxiláz inhibitorai és fibroszuppresszíváként és immunszuppresszíváként használhatók.

1. Eljárási (I) általános képletű vegyületek és fiziológiai állag alkalmás sóik előállítására, ahol

R1 jelentése 1-12 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben egy fenilcsoporttal vagy egy vagy két hidroxilcsoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-4 szénatomos mono- vagy dialkil-amino-csoporttal, halogénatommal vagy 1-4 szénatomos alkil-karbonil-oxi-csoporttal helyettesítve lehet vagy

R1 jelentése fenilcsoport vagy aminocsoport, amely adott esetben 1-4 szénatomos alkilcsoporttal mono- vagy diszubsztituált lehet,

R2 jelentése hidrogénatom, vagy

R1 és R2 a kapcsolódó nitrogénatommal egy (1) általános képletű csoportot alkot, ahol

n értéke 1 és 3 közötti egész szám,

X jelentése oxigénatom, kénatom, metilénicsoport, vagy egy

NR3 általános képletű csoport, és

R3 jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport -, azzal jellemzve, hogy egy (II) általános képletű vegyületet - ahol

Y jelentése halogénatom, hidroxilcsoport vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoport, vagy a karbonilcsoporttal együtt egy aktív észtercsoport vagy vegyes anhidridet alkot - egy (III) általános képletű vegyülettel, ahol R1 és R2 jelentése az (I) általános képletnél megadott, reagáltatunk, és kívánt esetben az R1 jelentésében 1-4 szénatomos alkoxi-(1-12 szénatomos alkil)-csoportot tartalmazó vegyületet R1 jelentésében hidroxi-(1-12 szénatomos alkil)-csoportot tartalmazó vegyületté hidrolizáljuk, és/vagy

Kívánt esetben az R1 jelentésében hidroxi-(1-12 szénatomos alkil)-csoportot tartalmazó vegyületet R1 jelentésében (1-4 szénatomos alkil-karbonil-oxi)-(1-12 szénatomos alkil)-csoportot tartalmazó vegyületté aclezzük, és/vagy

Kívánt esetben a kapott (I) általános képletű vegyületből fiziológiai állag alkalmás sót képzünk.

2. Az 1. igénypont szerinti eljárást olyan (I) általános képletű vegyületek és fiziológiai állag alkalmás sóik előállítására - ahol

R1 jelentése 1-12 alkilcsoport, amely adott esetben egy fenilcsoporttal vagy egy vagy két hidroxilcsoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-4 szénatomos mono- vagy di-alkil-amino-csoporttal, halogénatommal vagy 1-4 szénatomos alkil-karbonil-oxi-csoporttal helyettesítve lehet, vagy

R1 jelentése fenilcsoport, vagy

R1 jelentése aminocsoport amely szubsztituáltan vagy 1-3 szénatomos alkilcsoporttal helyettesítve van,

R2 jelentése hidrogénatom, vagy

R1 és R2 együttesen a közbezárt nitrogénatommal együtt egy (2) általános képletű csoportot alkot, ahol

X jelentése oxigénatom,

CH₂-csoport, vagy egy N-R3 általános képletű

/ / csoport, ahol

R3 jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport -, azzal jellemzve, hogy megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk.

3. Az 1. igénypont szerinti eljárást olyan (I) általános képletű vegyületek és fiziológiai állag alkalmás sóik előállítására, ahol

R1 jelentése 1-12 alkilcsoport, amely adott esetben egy fenilcsoporttal vagy egy vagy két hidroxilcsoporttal, 1-3 szénatomos alkoxicsoporttal, vagy di-(1-3 szénatomos alkil)-amino-csoporttal helyettesítve van, vagy

R1 jelentés fenilcsoport vagy aminocsoport,

R2 jelentése hidrogénatom, vagy

R1 és R2 együtt sen a közbezárt nitrogénatommal együtt egy (2) általános képletű csoportot alkot, ahol

X jelentése oxigénatom, CH₂-csoport, vagy egy

/ N-R3 általános képletű csoport, ahol

R3 jelentése hidrogénotom vagy metilcsoport, azzal jellemezve, hogy megfelelően helyettesített kiindulási vegyületeket alkalmazunk.

3/3
①